

特許出願

特許願

昭和 48 年 7 月 1 日

特許庁長官

1. 発明の名称

9-ハロゲノ-チアゾロキノリン類の製法

2. 発明者

第一薬業研究所 田中義重

第一薬業研究所内 田中義重 (他1名)

3. 特許出願人

東京都中央区日本橋3丁目14番10号

(283) 第二薬業株式会社

代表取締役 石原義重

4. 代理人

東京都中央区日本橋3丁目14番10号 103

第二薬業株式会社内 電話(272)0611

内文文部省

5. 添付書類の目録

(1) 男稿書 1通 (2) 契約状 1通



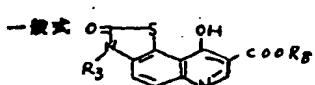
方 式
審査

明 講 書

1. 発明の名称

9-ハロゲノ-チアゾロキノリン類の製法。

2. 特許請求の範囲



(式中 R₃ は低級アルキル基、低級アルケニル基、R₄ は水素原子又は低級アルキル基を示す。) で表わされる 9-ヒドロキシチアゾロ(5,4-エ)キノリン-8-カルボン酸誘導体とハロゲン化剤とを反応させることを特徴とする一般式



(式中 X はハロゲン原子を示し、R₃, R₄ は前記に同じ。) で表わされる 9-ハロゲノチアゾロ(5,4-エ)キノリン-8-カルボン酸誘導体の製造法。

3. 発明の詳細を説明

⑯ 日本国特許庁

公開特許公報

⑪特開昭 50-25595

⑫公開日 昭 50.(1975) 3. 18

⑬特願昭 48-77311

⑭出願日 昭 48.(1973) 7. 9

審査請求 未請求 (全2頁)

府内整理番号

6736.04

7043.04

⑮日本分類

16 E622

30 B1

⑯ Int.C12

C07D513/04//

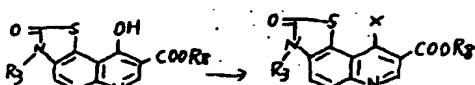
A61K 31/47

(C07D513/04

C07D221/00

C07D277/00)

本発明は新規な 9-ハロゲノ-チアゾロキノリン誘導体の製造法に関するものであり、反応式で示せば次の通りである。



(II) (I)

(式中 R₃ は低級アルキル基、低級アルケニル基、R₄ は水素原子又は低級アルキル基を示し、X はハロゲン原子を示す。)

すなわち、本発明は 5-置換-2,3-ジヒドロ-9-ハイドロキシ-2-オキソ-チアゾロ(5,4-エ)キノリン-8-カルボン酸誘導体(II)をハロゲン化剤と反応させて 5-置換-2,3-ジヒドロ-9-ハロゲノチアゾロ(5,4-エ)キノリン-8-カルボン酸誘導体(I)を製造する方法である。

出発原料の(II)は、2-メチルチオ-9-ハイドロオキシチアゾロ(5,4-エ)キノリン-8-カルボン酸又はそのエステル類にジアルキル

硫酸を反応せしめて、3-アルキル-2-メチルオーニ-9-ハイドロオキシチアゾロ(3,4-エ)キノリン-8-カルボン酸又はそのエステル類のアルキル硫酸塩とし、これを加水分解することにより容易に製造される(特願昭46-063266参照)。

(I)を製するには、通常(I)とハロゲン化剤との混合物を室温乃至150°Cに数時間~数十時間加熱すればよく、ハロゲン化剤の種類によつて反応条件は異なるが、一般に90~110°Cにて2~10時間加熱するのがよい。

ハロゲン化剤としては、オキシ塩化鉄、五塩化鉄、三塩化鉄、オキシ臭化鉄などの鉄ハロゲン化物又はそれらの混合物などが用いられる。

この様にして得られる化合物(I)は、すべて新規化合物であり、それ自身、抗原虫、抗真菌、抗菌作用を示すと共に、優れた抗菌作用を示す3,6-ジ置換-2,5,6,9-テトラヒドロチアゾロ(3,4-エ)キノリン-8-カルボン酸又は3,9-ジ置換-2,8-ジヒドロチアゾロ

(3,4-エ)キノリン-8-カルボン酸塩の類

の中間体として価値ある化合物である。

実施例

2,3-ジヒドロ-3-メチル-9-ハイドロオキシチアゾロ(3,4-エ)キノリン-8-カルボン酸エチルエステル3g、オキシ塩化鉄150gの混合物を3時間加熱混流する。反応液を減圧濃縮後、氷水中にあけ、アルカリにて中和し、クロロホルムにて抽出する。抽出液を乾燥後、溶媒を留去し、残渣にエーテルを加えて析出する微黄色結晶を濾取すれば、融点185°Cの2,3-ジヒドロ-3-メチル-9-クロル-チアゾロ(3,4-エ)キノリン-8-カルボン酸エチルエステル3g(收率95%)が得られる。

元素分析値 C₁₄H₁₁N₂O₃S02

計算値 C 62.02 H 3.45 N 8.66

実験値 C 61.72 H 3.52 N 8.66

6. 前記以外の発明者

〒174-0043
東京都江戸川区南葛西町2610
第一製薬研究所内
日本製薬